

日本薬局方 アンレキサノクス錠

ソルファ[®] 25mg錠
ソルファ[®] 50mg錠

「タケダ」

SOLFA[®] 25mg. & 50mg. TABLETS

	承認番号	薬価収載	販売開始
25mg (1AM)	494	1989年12月	1989年12月
50mg (62AM)	1000	1987年8月	1987年11月
		効能追加	1989年9月
		再審査結果	1994年9月

貯法：室温保存
使用期限：外箱に表示の使用期限内に使用すること。
(使用期限内であっても開封後はなるべく速やかに使用すること。)

【組成・性状】

本剤は日本薬局方アンレキサノクス錠である。

	ソルファ25mg錠			ソルファ50mg錠		
1錠中の有効成分	アンレキサノクス25mg			アンレキサノクス50mg		
剤形	素錠			片面に割線の入った素錠		
錠剤の色	白色～帯黄白色					
識別コード	△ 270			△ 271		
形状	上面	下面	側面	上面	下面	側面
直径(mm)	7.1			8.0		
厚さ(mm)	2.6			3.1		

添加物：トウモロコシデンプン、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロースカルシウム、ステアリン酸マグネシウム、乳糖水和物

【効能・効果】

- 気管支喘息
- アレルギー性鼻炎

【用法・用量】

◇気管支喘息の場合

通常、成人には症状に応じて1回アンレキサノクスとして25～50mgを1日3回、朝、夕及び就寝前に経口投与する。

◇アレルギー性鼻炎の場合

通常、成人には症状に応じて1回アンレキサノクスとして25～50mgを1日3回、朝、昼及び夕に経口投与する。

【使用上の注意】

1. 重要な基本的注意

- (1)本剤の投与にあたっては、症状により用量を適宜増減すること。
通常、中等症以上には用法・用量に記載の高用量を、軽症又は症状が軽快した場合には低用量を投与する。
- (2)本剤は気管支拡張剤、ステロイド剤、抗ヒスタミン剤等と異なり、すでに起こっている発作や症状を速やかに軽減する薬剤ではないので、このことは患者に十分説明しておくこと。
- (3)本剤を季節性の患者に投与する場合は、好発季節を考慮して、その直前から投与を開始し、好発季節終了時まで続けること。
- (4)気管支喘息患者に本剤を投与中、大発作をみた場合は、気管支拡張剤あるいはステロイド剤を投与すること。
- (5)長期ステロイド療法を受けている患者で、本剤投与によりステロイドの減量をはかる場合は、十分な管理下で徐々に行うこと。
- (6)本剤の使用によりステロイド維持量を減量し得た患者で、本剤の投与を中止する場合は、原疾患再発のおそれがあるので注意すること。

2. 副作用

承認時までの調査では1,122例中118例(10.5%)に、市販後の使用成績調査(再審査終了時点)では6,401例中168例(2.6%)に臨床検査値の異常を含む副作用が認められている。

以下の副作用は上記の調査あるいは自発報告等で認められたものである。

	0.1～5%未満	0.1%未満
1)過敏症 ^{注)}	発疹、掻痒	呼吸困難
2)消化器	悪心、嘔吐、食欲不振、胃部不快感、胃痛、腹痛、下痢	胃もたれ
3)肝臓	AST(GOT)、ALT(GPT)の上昇	黄疸、AL-P、LDH、 γ -GTPの上昇
4)精神神経系	頭痛、眠気、振戦	めまい、しびれ感
5)腎臓		BUNの上昇、尿蛋白の増加、頻尿
6)血液	好酸球増多	
7)その他		動悸、ほてり、全身倦怠感、浮腫

注) このような場合には投与を中止すること。

3. 妊婦、産婦、授乳婦等への投与

- (1)妊婦又は妊娠している可能性のある婦人には治療上の有益性が危険性を上まわると判断される場合にのみ投与すること。[妊娠中の投与に関する安全性は確立していない。]
- (2)授乳中の婦人に投与する場合には授乳を避けさせること。
[動物試験(ラット)で母乳中へ移行することが報告されている。]

4. 小児等への投与

低出生体重児、新生児、乳児、幼児、小児に対する安全性は確立していない(使用経験が少ない)。

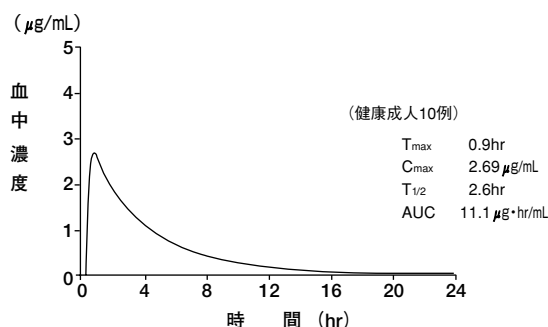
5. 適用上の注意

薬剤交付時：PTP包装の薬剤はPTPシートから取り出して服用するよう指導すること。[PTPシートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することが報告されている。]

【薬物動態】

1. 血中濃度

健康成人(10例)に1回50mgを食後に経口投与した場合、血中には主としてアンレキサノクスの未変化体が検出され、未変化体の血中濃度は、0.9時間でピーク(2.69 μ g/mL)に達し、半減期は2.6時間である。



2. 排泄

健康成人(10例)に1回50mgを食後に経口投与した場合、尿中にはアンレキサノクスの未変化体及び代謝物(水酸化体)が検出され、投与後24時間までの尿中排泄は、それぞれ平均12.3%及び19.0%で、それらの大部分は投与後11時間以内に排泄される。

【臨床成績】

1. 気管支喘息²⁻⁸⁾

気管支喘息患者397例を対象に、一般臨床試験では1日75～150mg(主として150mg)[1回25～50mg、1日3回]を主として4～8週間、二重盲検比較対照試験では1日150mg(1回50mg、1日3回)を6週間投与した臨床試験において、最終全般改善度は、中等度改善以上では31%(125/397例)、軽度改善以上では62%(248/397例)である。

なお、気管支喘息患者を対象とした二重盲検比較対照試験の結果、本剤の有用性が認められている。

2. アレルギー性鼻炎⁹⁻¹⁵⁾

通年性アレルギー性鼻炎患者626例を対象に、一般臨床試験では1日75～150mg(主として150mg)[1回25～50mg、1日3回]を主として4～16週間、二重盲検比較対照試験では1日150mg(1回50mg、1日3回)を4週間投与した臨床試験において、最終全般改善度は、中等度改善以上では53%(330/626例)、軽度改善以上では83%(517/626例)である。

なお、通年性アレルギー性鼻炎患者を対象とした二重盲検比較対照試験の結果、本剤の有用性が認められている。

【薬効薬理】

本剤は、アレルギー反応におけるヒスタミン遊離抑制作用・ロイコトリエン生成抑制作用及び抗ロイコトリエン作用に基づく抗喘息作用並びにアレルギー性鼻炎抑制作用を有している。なお、抗ヒスタミン作用は認められていない。

1. ヒスタミン遊離抑制作用^{16,17)}

ラット肥満細胞からのIgE関与のヒスタミン遊離反応(*in vitro*)を抑制する。ヒスタミン遊離抑制の作用機序として肥満細胞におけるc-AMP量増加作用に基づくことが示唆されている。

2. ロイコトリエン生成抑制作用¹⁸⁻²⁰⁾

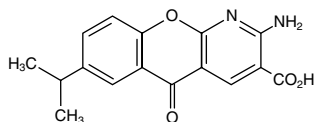
ヒト白血球からのロイコトリエン生成(*in vitro*)、感作モルモット肺切片における抗原惹起のロイコトリエン生成(*in vitro*)、及びラット腹腔マクロファージにおけるカルシウムイオノフォア刺激によるロイコトリエン生成(*in vitro*)をいずれも抑制する。

3. 抗ロイコトリエン作用²¹⁾

モルモット摘出肺及び回腸標本においてロイコトリエンにより惹起される平滑筋収縮反応(*in vitro*)を抑制する。

【有効成分に関する理化学的知見】

化学構造式：



一般名：アンレキサノクス(Amlexanox)〔JAN〕

化学名：2-Amino-7-(1-methylethyl)-5-oxo-5H-[1]benzopyrano[2,3-b]pyridine-3-carboxylic acid

分子式：C₁₆H₁₄N₂O₄

分子量：298.29

融点：温度の上昇とともにわずかに黄色を帯びるが、320℃でも明確な融点及び分解点を示さない。

性状：アンレキサノクスは白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。エタノール(99.5)に極めて溶けにくく、水にほとんど溶けない。薄めた水酸化ナトリウム試液(1→3)に溶ける。

**【包装】

25mg錠：100錠(10錠×10)

50mg錠：100錠(10錠×10)

【主要文献】

- 1) 鳥井 洋 他：薬理と治療, **13**(9)：4933, 1985.
- 2) 岸本 進 他：ibid., **14**(4)：2895, 1986.
- 3) 岸本 進 他：医学のあゆみ, **138**(13)：1005, 1986.
- 4) 大久保隆男 他：Therapeutic Research, **4**(2)：261, 1986.
- 5) 大原守弘 他：薬理と治療, **14**(3)：1901, 1986.
- 6) 信太隆夫 他：臨床医薬, **2**(3)：399, 1986.
- 7) 川合 満 他：Therapeutic Research, **8**(5)：1443, 1988.
- 8) 黒川伝太郎 他：ibid., **8**(6)：1837, 1988.
- 9) 奥田 稔 他：耳鼻咽喉科展望, **31**(補3)：281, 1988.
- 10) 竹中 洋 他：アレルギー, **37**(11)：1094, 1988.
- 11) 辻 久茂 他：耳鼻咽喉科臨床, **81**(9)：1357, 1988.
- 12) 高坂知節 他：ibid., **81**(6)：917, 1988.
- 13) 藤崎恭大 他：Therapeutic Research, **8**(1)：335, 1988.
- 14) 竹林脩文 他：耳鼻咽喉科展望, **31**(補3)：271, 1988.
- 15) 榎本雅夫 他：耳鼻咽喉科臨床, **81**(8)：1223, 1988.
- 16) 栗木 久 他：薬理と治療, **16**(10)：4153, 1988.
- 17) Makino, H. et al.: Int. Archs Allergy Appl. Immun., **82**：66, 1987.
- 18) Saijo, T. et al.: ibid., **77**：315, 1985.
- 19) 榎原博樹 他：臨床と研究, **65**(9)：2960, 1988.
- 20) Saijo, T. et al.: Int. Archs Allergy Appl. Immun., **79**：231, 1986.
- 21) 栗木 久 他：薬理と治療, **13**(11)：6435, 1985.

*【文献請求先・製品情報お問い合わせ先】

武田薬品工業株式会社 医薬学術部 くすり相談室
〒103-8668 東京都中央区日本橋二丁目12番10号
フリーダイヤル 0120-566-587

受付時間 9:00～17:30 (土日祝日・弊社休業日を除く)

製造販売元

武田薬品工業株式会社

〒540-8645 大阪市中央区道修町四丁目1番1号